# This Page Is Inserted by IFW Operations and is not a part of the Official Record

# **BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images may include (but are not limited to):

- BLACK BORDERS
- TEXT CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- FADED TEXT
- ILLEGIBLE TEXT
- SKEWED/SLANTED IMAGES
- COLORED PHOTOS
- BLACK OR VERY BLACK AND WHITE DARK PHOTOS
- GRAY SCALE DOCUMENTS

# IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning documents will not correct images, please do not report the images to the Image Problem Mailbox.

- (9) BUNDESREPUBLIK
  - **DEUTSCHLAND**
- Offenlegungsschrift
- <sub>(1)</sub> DE 3825041 A1



**PATENTAMT** 

- (21) Aktenzeichen:

P 38 25 041.1

Anmeldetag:

20. 7.88

Offenlegungstag:

15. 2.90:



(5) Int. Cl. 5:

C07 D 471/14

A 01 N 43/90 A 01 N 47/24 A 01 N 47/34 // (C07D 471/14, 221:00,239:00,249:00 213:02, 333:04)C07D 249/14,

401/12,409/12

(71) Anmelder:

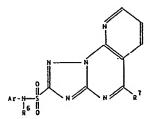
Schering AG, Berlin und Bergkamen, 1000 Berlin, DE

② Erfinder:

Wegner, Peter, Dipl.-Chem. Dr.; Krüger, Martin, Dipl.-Chem. Dr.; Krüger, Gabriele, Dipl.-Chem. Dr., 1000 Berlin, DE; Head, John, Dr., Bishop's Stortford, Hertfordshire, GB; Rees, Richard, Dipl.-Biol. Dr.; Johann, Gerhard, Dipl.-Agr.-Ing. Dr., 1000 Berlin, DE

(M) Pyrido[3,2-e][1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin- 2-sulfonsäureamide, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Mittel mit herbizider, pflanzenwachstumsregulierender und fungizider Wirkung

Die Erfindung betrifft neue Pyrido [3,2-e] [1,2,4] triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-sulfonsäureamide der allgemeinen Formel I



(1)

in der Ar, R<sup>6</sup> und R<sup>7</sup> die in der Beschreibung genannten Bedeutungen haben, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Mittel mit herbizider, pflanzenwachstumsregulierender und fungizider Wirkung.

#### Beschreibung

Die Erfindung betrifft neue Pyrido[3,2-e][1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-sulfonsäureamide, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Mittel mit herbizider, pflanzenwachstumsregulierender und fungizider Wirkung.

Es ist bereits bekannt, daß Triazolsulfonamide eine herbizide Wirkung besitzen (EP-Anmeldungen 01 42 152, 01 50 974 und 02 46 749). Häufig ist jedoch die Herbizidwirkung der bekannten Verbindungen nicht ausreichend, beziehungsweise es treten bei entsprechender Herbizidwirkung Selektivitätsprobleme in landwirtschaftlichen Hauptkulturen auf.

Aufgabe der vorliegenden Erfindung ist die Bereitstellung von neuen Verbindungen, die diese Nachteile nicht aufweisen und in ihren biologischen Eigenschaften den bisher bekannten Verbindungen überlegen sind.

Es wurde nun gefunden, daß Pyrido[3,2-e]1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-sulfonsäureamide der allgemeinen Formel I

15
$$N-N$$

$$Ar-N-S$$

$$R^{6}$$

$$O$$

$$N$$

$$N$$

$$N$$

$$R^{7}$$

$$R^{7}$$

in der

25

Ar eine Phenyl-, Naphthyl-, Pyridyl- oder Thienylgruppe der allgemeinen Formeln

R1, R2, R3, R4 und R5, die gleich oder verschieden sind, ein Wasserstoffatom, einen C1-C6-Alkylrest, einen einoder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy, Halogen-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, Halogen- $C_1$ - $C_4$ -alkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylthio,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylsulfinyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkylsulfonyl substituierten C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylrest, einen C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenylrest, einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen,  $Hydroxy, Halogen-C_1-C_4-alkyl, C_1-C_4-Alkoxy, Halogen-C_1-C_4-alkoxy, C_1-C_4-Alkylsulfi-Alkylsulfi-C_4-alk$ nyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyl substituierten C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenylrest, einen C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinylrest, einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy, Halogen-C1-C4-alkyl, C1-C4-Alkoxy, Halogen- $C_1-C_4$ -alkoxy,  $C_1-C_4$ -Alkylthio,  $C_1-C_4$ -Alkylsulfinyl oder  $C_1-C_4$ -Alkylsulfonyl substituierten  $C_2-C_6$ -Alkinylrest, ein Halogenatom, eine C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxygruppe, eine Halogen-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxygruppe, eine Gruppe R<sup>8</sup>-O-CO-, eine Aminocarbonylgruppe R<sup>9</sup>R<sup>10</sup>N-CO-, eine Aminogruppe R<sup>9</sup>R<sup>10</sup>N-, eine Cyanogruppe, eine Nitrogruppe, eine Schwefel enthaltende Gruppe  $R^8-S(O)_n$ , eine Acylgruppe  $R^8-CO$ , eine Gruppe  $R^8-O-CO-(CH_2)_n$ , einen Phenylrest, einen durch  $C_1-C_4$ -Alkyl, Halogen oder Nitro substituierten Phenylrest, einen durch  $C_1$ -C4-Alkyl, Halogen oder Nitro substituierten Phenylrest, einen durch  $C_1$ -C4-Alkyl, Halogen oder Nitro substituierten Phenylrest, einen durch  $C_1$ -C4-Alkyl, Halogen oder Nitro substituierten Phenylrest, einen durch  $C_1$ -C4-Alkyl, Halogen oder Nitro substituierten Phenylrest, einen durch  $C_1$ -C4-Alkyl, Halogen oder Nitro substituierten Phenylrest, einen durch  $C_1$ -C4-Alkyl, Halogen oder Nitro substituierten Phenylrest, einen durch  $C_1$ -C4-Alkyl, Halogen oder Nitro substituierten Phenylrest, einen  $C_1$ -C4-Alkyl, einen  $C_2$ -C4-Alkyl, einen  $C_1$ -C4-Alkyl, einen  $C_2$ -C4-Alkyl, einen  $C_2$ -C4-Alkyl, einen  $C_2$ -C4-Alkyl, einen  $C_2$ -C4-Alkyl, rest, einen Phenoxyrest oder einen durch C1-C4-Alkyl, Halogen oder Nitro substituierten Phenoxyrest, R<sup>6</sup> ein Wasserstoffatom, eine Acylgruppe R<sup>8</sup>-CO-, eine Gruppe R<sup>8</sup>-O-CO-, einen C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylrest, einen C2-C6-Alkenylrest, einen C2-C6-Alkinylrest, einen Phenyl-C1-C4-alkylrest, eine Aminocarbonylgruppe R<sup>9</sup>R<sup>10</sup>N-CO-, ein Alkalimetallatom, ein einwertiges Metalläquivalent aus der Gruppe der Erdalkalimetalle und weiterer Metalle, einen Ammoniumrest oder einen durch C1-C6-Alkyl substituierten Ammoniumrest, R7 ein Wasserstoffatom, einen C1-C6-Alkylrest, einen durch Halogen und/oder C1-C4-Alkoxy substituierten C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylrest, einen C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenylrest, einen durch Halogen und/oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxysubstituierten C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenylrest, einen C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinylrest, einen durch Halogen und/oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituierten C2-C6-Alkinylrest, ein Halogenatom, eine Hydroxygruppe, einen C1-C6-Alkoxyrest, einen Halogen-C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>-alkoxyrest, eine Schwefel enthaltende Gruppe R<sup>8</sup>—S(O)<sub>n</sub>— oder eine Aminogruppe R<sup>9</sup>R<sup>10</sup>N— R8 ein Wasserstoffatom, einen C1-C6-Alkylrest, einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch

1

10

15

20

45

55

Halogen, Hydroxy oder  $C_1-C_4$ -Alkoxy substituierten  $C_1-C_6$ -Alkylrest, einen  $C_2-C_6$ -Alkenylrest, einen einoder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy oder  $C_1-C_4$ -Alkoxy substituierten  $C_2-C_6$ -Alkenylrest, einen  $C_2-C_6$ -Alkinylrest, einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy oder  $C_1-C_4$ -Alkoxy substituierten  $C_2-C_6$ -Alkinylrest, einen Phenyl- $C_1-C_4$ -alkylrest, einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy oder  $C_1-C_4$ -Alkoxy substituierten Phenyl- $C_1-C_4$ -alkylrest, einen Phenylrest oder einen durch Halogen, Nitro oder  $C_1-C_4$ -Alkyl substituierten Phenylrest,

 $R^9$  ein Wasserstoffatom, einen  $C_1-C_6$ -Alkylrest, einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy oder  $C_1-C_4$ -Alkoxy substituierten  $C_1-C_6$ -Alkylrest, einen  $C_2-C_6$ -Alkenylrest, einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy oder  $C_1-C_4$ -Alkoxy substituierten  $C_2-C_6$ -Alkenylrest, einen  $C_2-C_6$ -Alkinylrest, einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy oder  $C_1-C_4$ -Alkoxy substituierten  $C_2-C_6$ -Alkinylrest,

 $R^{10}$  ein Wasserstoffatom, einen  $C_1-C_6$ -Alkylrest, einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy oder  $C_1-C_4$ -Alkoxy substituierten  $C_1-C_6$ -Alkylrest, einen  $C_2-C_6$ -Alkenylrest, einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy oder  $C_1-C_4$ -Alkoxy substituierten  $C_2-C_6$ -Alkenylrest, einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy oder  $C_1-C_4$ -Alkoxy substituierten  $C_2-C_6$ -Alkinylrest, oder

 $R^9$  und  $R^{10}$  gemeinsam mit dem benachbarten Stickstoffatom eine Pyrolidinylgruppe, eine Piperidinogruppe oder eine Morpholinogruppe und  $n\,0,1$  oder 2

bedeuten, eine interessante herbizide, pflanzenwachstumsregulierende und fungizide Wirkung zeigen.

Der Begriff "Halogen" im Zusammenhang mit Alkyl, Alkenyl, Alkinyl oder Phenyl bedeutet, daß ein oder mehrere Wasserstoffatome durch ein oder mehrere Halogenatome ersetzt sind. Die Bezeichnung "Halogen" umfaßt Fluor, Chlor, Brom und Jod.

Als besonders wirksam haben sich solche Pyrido[3,2-e][1,2,4]triazolo-[1,5-a]pyrimidin-2-sulfonsäureamide der allgemeinen Formel I erwiesen, bei denen

Ar eine Phenylgruppe der allgemeinen Formel

$$R^4$$
 $R^5$ 
 $R^2$ 
 $R^1$ 
 $R^1$ 

R¹ und R⁵, die gleich oder verschieden sind, ein Halogenatom, einen Methylrest, einen Trifluormethylrest, eine Nitrogruppe, einen Methoxyrest oder eine Methoxycarbonylgruppe,

 $R^2$ ,  $R^3$  und  $R^4$ , die gleich oder verschieden sind, ein Wasserstoffatom, ein Halogenatom, einen Trifluormethylrest oder einen  $C_1 - C_4$ -Alkylrest,

R<sup>6</sup> ein Wasserstoffatom, ein einwertiges Metalläquivalent oder eine C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Acylgruppe und

 $R^7$  ein Wasserstoffatom, einen  $C_1 - C_4$ -Alkylrest, einen  $C_2 - C_4$ -Alkenylrest oder einen  $C_1 - C_4$ -Alkoxyrest

#### bedeuten.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel I können zum Beispiel hergestellt werden, indem man

A) Amine der allgemeinen Formel II

$$Ar - NH - R^{11}$$
 (II)

in der Ar die unter der allgemeinen Formel I angegebene Bedeutung hat und  $R^{11}$  ein Wasserstoffatom, einen  $C_1-C_6$ -Alkylrest, einen  $C_2-C_6$ -Alkenylrest oder einen  $C_2-C_6$ -Alkinylrest bedeutet, mit einem Sulfonsäurechlorid der allgemeinen Formel III

$$CI = S \qquad N \qquad N \qquad R$$

$$CI = S \qquad N \qquad N \qquad R$$

$$GS \qquad GS \qquad GS$$

in der R7 die unter der allgemeinen Formel I angegebene Bedeutung hat, in einem geeigneten Lösungsmittel

in Gegenwart eines Säureakzeptors umsetzt, B) eine Verbindung der allgemeinen Formel IV

$$Ar = N - S \qquad NH_{2}$$

$$R^{11} O$$

$$(IV)$$

in der Ar und  $\mathbb{R}^{11}$  die unter der allgemeinen Formel II angegebenen Bedeutungen haben, mit 2-Chlornicotinsäure der Formel  $\mathbb{V}$ 

10

15

20

25

30

35

40

45

50

55

65

in einem geeigneten Lösungsmittel in Gegenwart eines Säureakzeptors und weiterer Katalysatoren zu Verbindungen der allgemeinen Formel Ia

$$A_{I}-N-S \\ \downarrow \\ \downarrow \\ R^{II} O$$

$$N-N \\ \downarrow \\ N \\ OH$$

$$OH$$

in der Ar und  $\mathbb{R}^{11}$  die unter der allgemeinen Formel II angegebenen Bedeutungen haben, umsetzt, C) eine Verbindung der allgemeinen Formel Ia

in der Ar und R<sup>11</sup> die unter der allgemeinen Formel II angegebenen Bedeutungen haben, mit einem Halogenierungsreagenz in einem geeigneten Lösungsmittel in Gegenwart eines Katalysators zu Verbindungen der allgemeinen Formel Ib

in der Ar und R<sup>11</sup> die unter der allgemeinen Formel II angegebenen Bedeutungen haben und Hal ein Halogenatom bedeutet, umsetzt,

#### D) eine Verbindung der allgemeinen Formel Ia

Ar—N—S OH (Ia)

R" O

in der Ar und R<sup>11</sup> die unter der allgemeinen Formel II angegebenen Bedeutungen haben, mit Lawesson's Reagenz oder Phosphorpentasulfid in einem geeigneten Lösungsmittel und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators zu Verbindungen der allgemeinen Formel Ic

 $Ar - N - S \qquad N \qquad SH$   $\begin{vmatrix}
N - N & S & SH \\
R & O & SH
\end{vmatrix}$ 25

in der Ar und R<sup>11</sup> die unter der allgemeinen Formel II angegebenen Bedeutungen haben, umsetzt, E) eine Verbindung der allgemeinen Formel Ib

. in der Ar und R<sup>11</sup> die unter der allgemeinen Formel II angegebenen Bedeutungen haben und Hal ein Halogenatom bedeutet, mit einem Alkohol der allgemeinen Formel VI

 $HO-R^{12}$  (VI)

in der  $R^{12}$  einen  $C_1-C_6$ -Alkylrest oder einen Halogen- $C_1-C_6$ -alkylrest bedeutet, mit einer Schwefel enthaltenden Verbindung der allgemeinen Formel VII

 $HS(O)_n - R^8$  (VII)

in der  $\mathbb{R}^8$  und n die unter der allgemeinen Formel I angegebenen Bedeutungen haben, oder einem Amin der allgemeinen Formel VIII

 $H-NR^9R^{10}$  (VIII)

in der R<sup>9</sup> und R<sup>10</sup> die unter der allgemeinen Formel I angegebenen Bedeutungen haben, in einem geeigneten Lösungsmittel und in Gegenwart eines Säureakzeptors oder Katalysators zu Verbindungen der allgemeinen Formel Id

65

$$A_{I} = N - S$$

$$\downarrow N - N$$

$$\downarrow N$$

40 .

in der Ar und  $R^{11}$  die unter der allgemeinen Formel II angegebenen Bedeutungen haben und  $R^{13}$  einen  $C_1-C_6$ -Alkoxyrest, einen Halogen- $C_1-C_6$ -alkoxyrest, eine Schwefel enthaltende Gruppe  $R^8-S(O)_n$ -oder eine Aminogruppe  $R^9R^{10}N$ - bedeutet, wobei  $R^8$ ,  $R^9$ ,  $R^{10}$  und n die unter der allgemeinen Formel I angegebenen Bedeutungen haben, umsetzt,  $R^8$ 0 eine Verbindung der allgemeinen Formel Ic

$$\begin{array}{c|c}
N-N \\
0 \\
N-N \\
N \\
N \\
SH
\end{array}$$
(1c)

in der Ar und R<sup>11</sup> die unter der allgemeinen Formel II angegebenen Bedeutungen haben, mit einer Verbindung der allgemeinen Formel IX

in der  $R^{14}$  ein Wasserstoffatom, einen  $C_1-C_5$ -Alkylrest, einen  $C_2-C_5$ -Alkenylrest oder einen  $C_2-C_5$ -Alkinylrest bedeutet, in einem geeigneten Lösungsmittel in Gegenwart eines Säureakzeptors und gegebenenfalls eines Katalysators zunächst zu Verbindungen der allgemeinen Formel X

in der Ar und R<sup>11</sup> die unter der allgemeinen Formel II und R<sup>14</sup> die unter der allgemeinen Formel IX angegebenen Bedeutungen haben, und anschließend durch Erhitzen in einem geeigneten Lösungsmittel in Gegenwart einer Base in einer Retro-Aldol-Reaktion zu Verbindungen der allgemeinen Formel Ie

$$A_{1}-N-S \qquad N-N \qquad CH_{1}-R^{14}$$

$$R'' O$$

in der Ar und R<sup>11</sup> die unter der allgemeinen Formel II und R<sup>14</sup> die unter der allgemeinen Formel IX angegebenen Bedeutungen haben, umsetzt, G) eine Verbindung der allgemeinen Formel If

10

15

20

25

30

60

$$A_{1} = \begin{bmatrix} N - N \\ 0 \\ N \end{bmatrix} \begin{bmatrix} N - N \\ N \end{bmatrix} \begin{bmatrix} N \\ N \end{bmatrix} \begin{bmatrix} N \\ N \end{bmatrix} \begin{bmatrix} N \\ N \end{bmatrix}$$

$$R^{15} O$$
(1f)

in der Ar und  $R^7$  die unter der allgemeinen Formel I angegebenen Bedeutungen haben und  $R^{15}$  ein Wasserstoffatom oder ein einwertiges Metalläquivalent bedeutet, mit Verbindungen der allgemeinen Formel XII

oder der allgemeinen Formel XIII

in denen  $R^8$  die unter der allgemeinen Formel I genannte Bedeutung hat, aber nicht für ein Wasserstoffatom steht, und Hal Chlor oder Brom bedeutet, oder der allgemeinen Formel XIV

$$R^8-CO-O-CO-R^8 \quad (XIV)$$

in der R<sup>8</sup> die oben genannte Bedeutung hat, in einem geeigneten Lösungsmittel umsetzt, H) eine Verbindung der allgemeinen Formel Ig

in der Ar und R<sup>7</sup> die unter der allgemeinen Formel I angegebenen Bedeutungen haben, mit einer Verbindung der allgemeinen Formel XV

$$M-Y$$
 (XV)

in der M ein einwertiges Metalläquivalent und Y ein Wasserstoffatom, eine Hydroxy-, Niederalkyl-, Niederalkoxy- oder Aminogruppe bedeutet, in einem Lösungsmittel umsetzt.

Die einzelnen Verfahrensvarianten werden vorzugsweise in Gegenwart eines Verdünnungsmittels durchgeführt. Zu diesem Zweck können sämtliche gegenüber den verwendeten Reagenzien inerte Lösungsmittel verwendet werden.

Beispiele für solche Lösungsmittel beziehungsweise Verdünnungsmittel sind Wasser, aliphatische, alicyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, die jeweils gegebenenfalls chloriert sein können, wie zum Beispiel Hexan,

Cyclohexan, Petrolether, Ligroin, Benzol, Toluol, Xylol, Methylenchlorid, Chloroform, Kohlenstofftetrachlorid, Ethylenchlorid und Trichlorethylen, Ether, wie zum Beispiel Diisopropylether, Dibutylether, Propylenoxid, Dioxan und Tetrahydrofuran, Ketone, wie zum Beispiel Aceton, Methylethylketon, Methylisopropylketon und Methylisobutylketon, Nitrile, wie zum Beispiel Acetonitril und Propionitril, Alkohole, wie zum Beispiel Methanol, Isopropanol, Butanol und Ethylenglycol, Ester, wie zum Beispiel Ethylacetat und Amylacetat, Säureamide, wie zum Beispiel Dimethylformamid und Dimethylacetamid, Sulfone und Sulfoxide, wie zum Beispiel Dimethylsulfoxid und Sulfolan, und Basen, wie zum Beispiel Pyridin.

Die Reaktionen werden vorzugsweise zwischen Raumtemperatur und dem Siedepunkt des jeweiligen Reaktionsgemisches durchgeführt. Die Reaktionen lassen sich bei dem Druck der Umgebung durchführen, wenngleich sie auch bei erhöhtem beziehungsweise vermindertem Druck durchgeführt werden können.

Die Verfahrensvariante A) wird vorzugsweise in chlorierten Kohlenwasserstoffen, wie Dichlormethan oder Dichlorethan, in Anwesenheit eines Katalysators beziehungsweise Säureakzeptors durchgeführt. Beispiele hierfür sind tertiäre Amine, wie zum Beispiel Triethylamin, Diisopropylethylamin, N-Methylmorpholin, 4-Dimethylaminopyridin und Pyridin. Pyridin kann sowohl als Katalysator als auch als Lösungsmittel bei dieser Reaktion verwendet werden.

Die Verfahrensvarianten B) bis F) werden bevorzugt in Gegenwart von Verdünnungsmitteln wie aliphatischen, alicyclischen und aromatischen Kohlenwasserstoffen, die jeweils gegebenenfalls chloriert sein können, wie zum Beispiel Hexan, Cyclohexan, Petrolether, Ligroin, Benzol, Toluol, Xylol, Methylenchlorid, Chloroform, Kohlenstofftetrachlorid, Ethylenchlorid und Trichlorethylen, Ethern, wie zum Beispiel Diisopropylether, Dibutylether, Propylenoxid, Dioxan und Tetrahydrofuran, Ketonen, wie zum Beispiel Aceton, Methylethylketon, Methylisopropylketon und Methylisobutylketon, Nitrilen, wie zum Beispiel Acetonitril und Propionitril, Estern, wie zum Beispiel Ethylacetat und Amylacetat, Säureamiden, wie zum Beispiel Dimethylformamid und Dimethylacetamid, Sulfoxiden und Sulfonen, wie zum Beispiel Dimethylsulfoxid und Sulfolan, und Basen, wie zum Beispiel Pyridin, und gegebenenfalls in Anwesenheit eines Katalysators beziehungsweise Säureakzeptors durchgeführt. Beispiele hierfür sind tertiäre Amine, wie zum Beispiel Triethylamin, Diisopropylethylamin, N-Methylmorpholin, 4-Dimethylaminopyridin oder Pyridin.

Die Verfahrensvariante G) wird vorzugsweise so durchgeführt, daß man eine Verbindung der allgemeinen Formel If in einem geeigneten Lösungsmittel mit Verbindungen der allgemeinen Formeln XII, XIII oder XIV umsetzt, die in der Regel schwer löslichen anorganischen Salze abfiltriert und die gewünschten Verbindungen nach Abdampfen der Lösungsmittel erhält.

Die Verfahrensvariante H) wird vorzugsweise so durchgeführt, daß man eine Verbindung der allgemeinen Formel Ig in einem geeigneten Lösungsmittel mit einer Metallbase, wie einem Metallhydroxid, Metallhydrid, Metallalkyl oder Metallamid, umsetzt und die in der Regel schwerer löslichen Salze abfiltriert oder nach Abdampfen der Lösungsmittel erhält.

Die nach den oben genannten Verfahren hergestellten erfindungsgemäßen Verbindungen können nach den üblichen Verfahren aus dem Reaktionsgemisch isoliert werden, beispielsweise durch Abdestillieren des eingesetzten Lösungsmittels bei normalem oder vermindertem Druck, durch Ausfällen mit Wasser oder durch Extraktion.

Ein erhöhter Reinheitsgrad kann in der Regel durch säulenchromatographische Aufreinigung sowie durch fraktionierte Destillation oder Kristallisation erhalten werden.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen stellen in der Regel farb- und geruchlose Kristalle dar, die wenig löslich in Wasser und in aliphatischen Kohlenwasserstoffen, wie Petrolether, Hexan, Pentan und Cyclohexan, gut löslich in halogenierten Kohlenwasserstoffen, wie Chloroform, Methylenchlorid und Tetrachlorkohlenstoff, aromatischen Kohlenwasserstoffen, wie Benzol, Toluol und Xylol, Ethern, wie Diethylether, Tetrahydrofuran und Dioxan, Carbonsäurenitrilen, wie Acetonitril, Alkoholen, wie Methanol und Ethanol, Carbonsäureamiden, wie Dimethylsulfoxid, sind.

Die Sulfonsäurechloride der allgemeinen Formel III sind neu und lassen sich aus in der Literatur beschriebenen beziehungsweise nach bekannten Verfahren darstellbaren 2-Benzylthio-pyrido[3,2-e][1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidinen der allgemeinen Formel XVI

$$CH_2-S$$

$$N-N$$

$$N$$

$$R^7$$

$$(XVI)$$

50

55

in der R<sup>7</sup> die unter der allgemeinen Formel I angegebene Bedeutung hat, durch Umsetzung mit Chlor in Wasser oder Wasser/Essigsäuregemischen herstellen.

Amine der allgemeinen Formel II sind zum Teil käuflich oder nach bekannten beziehungsweise in der Literatur beschriebenen Verfahren darstellbar.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen zeigen eine gute herbizide Wirkung bei breitblättrigen Unkräutern und Gräsern. Ein selektiver Einsatz der erfindungsgemäßen Wirkstoffe ist in verschiedenen Kulturen möglich, zum Beispiel in Raps, Rüben, Sojabohnen, Baumwolle, Reis, Gerste, Weizen und anderen Getreidearten. Dabei sind einzelne Wirkstoffe als Selektivherbizide in Rüben, Baumwolle, Soja und Getreide besonders geeignet.

Ebenso können die Verbindungen zur Unkrautbekämpfung in Dauerkulturen, wie zum Beispiel Forst-, Ziergehölz-, Obst-, Wein-, Citrus-, Nuß-, Bananen-, Kaffee-, Tee-, Gummi-, Ölpalm-, Kakao-, Beerenfrucht- und Hopfenanlagen, und zur selektiven Unkrautbekämpfung in einjährigen Kulturen eingesetzt werden.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen können zum Beispiel bei den folgenden Pflanzengattungen verwendet werden:

Dikotyle Unkräuter der Gattungen Sinapis, Lepidium, Galium, Stellaria, Matricaria, Anthemis, Galinsoga, Chenopodium, Brassica, Urtica, Senecio, Amaranthus, Portulaca, Xanthium, Convolvulus, Ipomoea, Polygonum, Sesbania, Ambrosia, Cirsium, Carduus, Sonchus, Solanum, Rorippa, Lamium, Veronica, Abutilon, Datura, Viola, Galeopsis, Papaver, Centaurea und Chrysanthemum.

Monokotyle Unkrauter der Gattungen Avena, Alopecurus, Echinochloa, Setaria, Panicum, Digitaria, Poa, Eleusine, Brachiaria, Lolium, Bromus, Cyperus, Agropyron, Sagittaria, Monochoria, Fimbristylis, Eleocharis, Ischaemum und Apera.

Die Aufwandmengen schwanken je nach Anwendungsart im Vor- und Nachauflauf in Grenzen zwischen 0,01 bis 5 kg/ha.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können auch als Defoliant, Desiccant und als Krautabtötungsmittel verwendet werden. Sie beeinflussen auch das Pflanzenwachstum und können deshalb zur Wachstumsbeeinflussung von Kulturpflanzen eingesetzt werden. Einige dieser Wirkstoffe zeigen auch eine fungizide Wirkung.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen können entweder allein, in Mischung miteinander oder mit anderen Wirkstoffen angewendet werden. Gegebenenfalls können andere Pflanzenschutz- oder Schädlingsbekämpfungsmittel je nach dem gewünschten Zweck zugesetzt werden. Sofern eine Verbreiterung des Wirkungsspektrums beabsichtigt ist, können auch andere Herbizide zugesetzt werden. Beispielsweise eignen sich als herbizid wirksame Mischungspartner diejenigen Wirkstoffe, die in Weed Abstracts, Vol. 36, No. 12, 1987, unter dem Titel "List of common names and abbreviations employed for currently used herbicides and plant growth regulators in Weed Abstracts" aufgeführt sind.

Eine Förderung der Wirkintensität und der Wirkungsgeschwindigkeit kann zum Beispiel durch wirkungssteigernde Zusätze, wie organische Lösungsmittel, Netzmittel und Öle, erzielt werden. Solche Zusätze lassen daher gegebenenfalls eine Verringerung der Wirkstoffdosierung zu.

Zweckmäßig werden die gekennzeichneten Wirkstoffe oder deren Mischungen in Form von Zubereitungen, wie Pulvern, Streumitteln, Granulaten, Lösungen, Emulsionen oder Suspensionen, unter Zusatz von flüssigen und/oder festen Trägerstoffen beziehungsweise Verdünnungsmitteln und gegebenenfalls Haft-, Netz-, Emulgier- und/oder Dispergierhilfsmitteln angewandt.

Geeignete flüssige Trägerstoffe sind zum Beispiel aliphatische und aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Benzol, Toluol, Xylol, Cyclohexanon, Isophoron, Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid, weiterhin Mineralölfraktionen und Pflanzenöle.

Als feste Trägerstoffe eignen sich Mineralien, zum Beispiel Bentonit, Silicagel, Talkum, Kaolin, Attapulgit, Kalkstein, und pflanzliche Produkte, zum Beispiel Mehle.

An oberflächenaktiven Stoffen sind zu nennen zum Beispiel Calciumligninsulfonat, Polyethylenalkylphenylether, Naphthalinsulfonsäuren und deren Salze, Phenolsulfonsäuren und deren Salze, Formaldehydkondensate, Fettalkoholsulfate sowie substituierte Benzolsulfonsäuren und deren Salze.

Der Anteil des beziehungsweise der Wirkstoffe(s) in den verschiedenen Zubereitungen kann in weiten Grenzen variieren. Beispielsweise enthalten die Mittel etwa 10 bis 90 Gewichtsprozent Wirkstoff, etwa 90 bis 10 Gewichtsprozent flüssige oder feste Trägerstoffe sowie gegebenenfalls bis zu 20 Gewichtsprozent oberflächenaktive Stoffe.

Die Ausbringung der Mittel kann in üblicher Weise erfolgen, zum Beispiel mit Wasser als Träger in Spritzbrühmengen etwa 100 bis 1000 Liter/ha. Eine Anwendung der Mittel im sogenannten Low-Volume und Ultra-Low-Volume-Verfahren ist ebenso möglich wie ihre Applikation in Form von sogenannten Mikrogranulaten.

Die Herstellung dieser Zubereitungen kann in an sich bekannter Art und Weise, zum Beispiel durch Mahloder Mischverfahren, durchgeführt werden. Gewünschtenfalls können Zubereitungen der Einzelkomponenten auch erst kurz vor ihrer Verwendung gemischt werden, wie es zum Beispiel im sogenannten Tankmixverfahren in der Praxis durchgeführt wird.

Zur Herstellung der verschiedenen Zubereitungen werden zum Beispiel die folgenden Bestandteile eingesetzt:

#### A) Spritzpulver

1.) 25 Gewichtsprozent
60 Gewichtsprozent
10 Gewichtsprozent
5 Gewichtsprozent
Natriumsalz des N-Methyl-N-oleyl-taurins

Wirkstoff
Kaolin
Kieselsäure
einer Mischung aus dem Calciumsalz der Ligninsulfonsäure und dem
Natriumsalz des N-Methyl-N-oleyl-taurins

65

55

10

15

35

#### 38 25 041 DE

2.) 40 Gewichtsprozent 25 Gewichtsprozent

Wirkstoff **Tonmineralien** Kieselsäure

25 Gewichtsprozent 10 Gewichtsprozent

einer Mischung aus dem Calciumsalz der Ligninsulfonsäure und

Alkylphenylpolyglycolethern

#### B) Paste

45 Gewichtsprozent 10

Wirkstoff

5 Gewichtsprozent 15 Gewichtsprozent Natriumaluminiumsilikat Cetylpolyglycolether mit 8 Mol Ethylenoxid

2 Gewichtsprozent

Spindelöl

10 Gewichtsprozent

Polyethylenglycol

23 Gewichtsprozent 15

Wasser

#### C) Emulsionskonzentrat

25 Gewichtsprozent 20

Wirkstoff

15 Gewichtsprozent

Cyclohexanon

55 Gewichtsprozent

Xylol

5 Gewichtsprozent

einer Mischung aus dem Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure und

Nonylphenylpolyoxyethylen

25

5

Die nachstehenden Beispiele erläutern die Herstellung der erfindungsgemäßen Verbindungen:

#### Beispiel 1

30

5-Hydroxy-pyrido[3,2-e][1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-sulfonsäure-(2,6-dichloranilid)

15,79 g 5-Amino-1H-1,2,4-triazol-3-sulfonsäure-(2,6-dichloranilid) in 24 ml Dimethylformamid werden mit 8,08 g 2-Chlornicotinsaure, 12,98 g Kaliumcarbonat, 0,4 g Kupfer-Pulver und 0,2 g Kaliumjodid 5 Stunden unter Rühren auf 150°C erhitzt. Nach dem Abkühlen wird die Mischung in Wasser eingerührt und mit Salzsäure angesäuert. Das Produkt wird abgesaugt, mit Wasser und Ether gewaschen und im Vakuum bei 50°C getrocknet.

Ausbeute: 18,64 g=89% der Theorie Fp.: 337-340°C (Zers.)

40

#### Beispiel 2

# 5-Mercapto-pyrido[3,2-e][1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-sulfonsäure-(2,6-dichloranilid)

5,0 g 5-Hydroxy-pyrido[3,2-e][1,2,4]triazolo[1,5-]pyrimidin-2-sulfonsāure-(2,6-dichloranilid) werden in 60 ml Pyridin mit 3,69 g Phosphorpentasulfid 4 Stunden unter Rühren auf 100°C erhitzt. Nach dem Abkühlen wird das Pyridin im Vakuum abdestilliert. Der Rückstand wird in 2N Natronlauge aufgenommen und zweimal mit Methylenchlorid extrahiert. Die wäßrige Phase wird mit Salzsäure angesäuert und mit Methylenchlorid extrahiert. Das nach dem Einengen erhaltene Rohprodukt wird über Kieselgel chromatographiert.

Ausbeute: 4,27 g=83% der Theorie Fp.: 282-285°C

#### Beispiel 3

55

65

5-Methoxy-pyrido[3,2-e][1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-sulfonsäure-(2,6-dichloranilid)

2,0 g 5-Chlor-pyrido[3,2-e][1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-sulfonsāure-(2,6-dichloranilid) werden in 55 ml Methanol mit 5,5 ml Triethylamin 4 Stunden unter Rückfluß erhitzt. Das überschüssige Methanol wird abdestilliert und der Rückstand mit 2N Salzsäure-Lösung verrührt. Das Produkt wird abgesaugt, mit Wasser, Ether und Petan gewaschen und im Vakuum getrocknet.

Ausbeute: 0,93 g=47% der Theorie Fp.: 265-267°C

Analog zu den Beispielen 1 bis 3 lassen sich auch die folgenden erfindungsgemäßen Verbindungen herstellen.

Beispiel Nr.	Name der Verb	indung					kalische tante	
4	5-Methoxy-py	yrido[3,2-e][1,2,	4]triazolo[1,5-a]p	yrimidin-2-sulf	onsäure-	Fp.: 2	261-264°C	
5	(2-chlor-6-fluc 5-Hydroxy-py	rido[3,2́-e][1,2,₄	l]triazolo[1,5-a]p	yrimidin-2-sulf	onsäure-			
6	(2,6-dichlor-3- 5-Hydroxy-py	/rido[3,2-e][1,2,4	l]triazolo[1,5-a]p	yrimidin-2-sulfe	onsäure-	Fp.: 3	325—328°C	
7	(2-chlor-6-fluoranilid) 5-Methoxy-pyrido[3,2-e][1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-sulfonsäure- (2,6-dichlor-3-methylanilid)						Fp.: 264 – 268° C	
Die fo	lgenden Beispi	ele erläutern di	e Anwendungsm	löglichkeiten de	er erfindungsge	mäßen Verbind	ungen.	1
			Beis	spiel A		•		
dung in a Emulsior Wochen	einer Aufwand n oder Suspens nach der Beha	menge von 0,3 ion mit 500 Lit ndlung die erfin	führten Pflanzen kg Wirkstoff/ha ern Wasser/ha g dungsgemäße V gen das Unkraut	behandelt. Die deichmäßig übe erbindung eine	Verbindung wer die Pflanzen	urde zu diesen versprüht. Hier	n Zweck als	2
In der	folgenden Tab	elle bedeuten:						2
1 = 1	Schädigung 24% Schädigu					·		
3=75— 4=90—1	74% Schädigu 89% Schädigu 00% Schädigu	ng ng						3
3=75- 4=90-1 GOSHI= ALOMY MATCH SOLSS= VERPE=	89% Schädigu	ng ng rsutum myosuroides hamomilla				·		
3=75- 4=90-1 GOSHI= ALOMY MATCH SOLSS= VERPE= VIOSS=	89% Schädigu 00% Schädigu = Gossypium hi = Alopecurus i = Matricaria ci = Solanum sp. = Veronica pers Viola sp.  sgemäße	ng ng rsutum myosuroides hamomilla	ALOMY	MATCH	SOLSS	VERPE	VIOSS	3:
3 = 75 4 = 90 1 GOSHI = ALOMY MATCH SOLSS = VERPE = VIOSS = Erfindungs Verbindun	89% Schädigu 00% Schädigu = Gossypium hi = Alopecurus i = Matricaria cl = Solanum sp. = Veronica pers Viola sp. sgemäße	ng ng rsutum myosuroides hamomilla ica	ALOMY 4 0	MATCH 4 0	SOLSS 3 0	VERPE 4 0	VIOSS 3 0	3:
3=75- 4=90-1 GOSHI= ALOMY MATCH SOLSS= VERPE=	89% Schädigu 00% Schädigu = Gossypium hi = Alopecurus i = Matricaria cl = Solanum sp. = Veronica pers Viola sp. sgemäße	ng rsutum myosuroides hamomilla ica  GOSHI	4 0	4	3	4	3	34 40 45
3=75-4=90-1 GOSHI=ALOMY MATCH SOLSS=VERPE=VIOSS= Erfindungs Verbindun Beispiel 3 Jnbehand Im Gevelung in eiemulsion Vochen r	89% Schädigu 00% Schädigu = Gossypium hi = Alopecurus i = Matricaria ci solanum sp. = Veronica pers Viola sp.  sgemäße g delt wächshaus wur iner Aufwandn oder Suspensinach der Behar	rsutum myosuroides hamomilla iica  GOSHI  0 0 0  den die aufgefünenge von 0,1 lon mit 500 Lite adlung die erfin	4 0 Beis ihrten Pflanzens cg Wirkstoff/ha rn Wasser/ha gl dungsgemäße V	4 0 piel B pezies nach den behandelt. Die eichmäßig über	3 0 n Auflaufen mi Verbindung w die Pflanzen v	4 0 t der aufgeführt urde zu diesem ersprüht. Hier z	3 0 ten Verbin- Zweck als zeigte zwei	3.
3=75-4=90-1 GOSHI=ALOMY MATCH SOLSS=VERPE=VIOSS= Perfindungs Verbindungs Verbi	89% Schädigu 00% Schädigu = Gossypium hi = Alopecurus i = Matricaria ci solanum sp. = Veronica pers Viola sp.  sgemäße g delt wächshaus wur iner Aufwandn oder Suspensin ach der Behar zeichneter Wir	rsutum myosuroides hamomilla iica  GOSHI  0 0 0  den die aufgefünenge von 0,1 len mit 500 Lite idlung die erfinkung gegen das	4 0 Beis ihrten Pflanzens cg Wirkstoff/ha rn Wasser/ha gl dungsgemäße V	4 0 piel B pezies nach den behandelt. Die eichmäßig über	3 0 n Auflaufen mi Verbindung w die Pflanzen v	4 0 t der aufgeführt urde zu diesem ersprüht. Hier z	3 0 ten Verbin- Zweck als zeigte zwei	4
3=75— 4=90—1 GOSHI= ALOMY MATCH SOLSS= VERPE= VIOSS=  Erfindungs Verbindun  Beispiel 3 Jubehand  Im Gew lung in ei Emulsion Vochen r ei ausgez  In der fe = keine S = 1 — 2 = 25 — 7	89% Schädigu 00% Schädigu = Gossypium hi = Alopecurus i = Matricaria cl - Solanum sp. = Veronica pers Viola sp. sgemäße g delt wächshaus wurd noder Suspension ach der Behar zeichneter Wirt olgenden Tabe Schädigung 24% Schädigun 74% Schädigun	rsutum myosuroides hamomilla iica  GOSHI  0 0 0  den die aufgefünenge von 0,1 lon mit 500 Lite idlung die erfinkung gegen das lle bedeuten:	4 0 Beis ihrten Pflanzens cg Wirkstoff/ha rn Wasser/ha gl dungsgemäße V	4 0 piel B pezies nach den behandelt. Die eichmäßig über	3 0 n Auflaufen mi Verbindung w die Pflanzen v	4 0 t der aufgeführt urde zu diesem ersprüht. Hier z	3 0 ten Verbin- Zweck als zeigte zwei	4 4.
3=75-4 =90-1 GOSHI= ALOMY MATCH SOLSS= VERPE= VIOSS= Erfindungs Verbindun  Beispiel 3 Jubehand Im Gevelung in eie Emulsion Vochen r vei ausgez  In der fer = keine S = 1-2 = 25-7 = 75-8	89% Schädigu 00% Schädigu = Gossypium hi = Alopecurus i = Matricaria cl - Solanum sp. = Veronica pers Viola sp. sgemäße ig delt wächshaus wur iner Aufwandn oder Suspensin ach der Behar zeichneter Wir olgenden Tabe Schädigung 24% Schädigung	rsutum myosuroides hamomilla ica  GOSHI  0 0  den die aufgefünenge von 0,1 lon mit 500 Lite idlung die erfinkung gegen das lle bedeuten:	4 0 Beis ihrten Pflanzens cg Wirkstoff/ha rn Wasser/ha gl dungsgemäße V	4 0 piel B pezies nach den behandelt. Die eichmäßig über	3 0 n Auflaufen mi Verbindung w die Pflanzen v	4 0 t der aufgeführt urde zu diesem ersprüht. Hier z	3 0 ten Verbin- Zweck als zeigte zwei	3 4 4

	Erfindungsgemäße Verbindung	ZEAMX	IPOSS	MATCH	SOLSS	VERPE
;	Beispiel 3 Unbehandelt	1 0	3 0	4 0	4 0	4 0

#### Patentansprüche

1. Pyrido[3,2-e][1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-sulfonsäureamide der allgemeinen Formel I

$$\begin{array}{c|c}
N-N \\
0 \\
N-N \\
N \\
R^7
\end{array}$$

$$\begin{array}{c|c}
R^7 \\
R^6 \\
0
\end{array}$$

in der Ar eine Phenyl-, Naphthyl-, Pyridyl- oder Thienylgruppe der allgemeinen Formeln

R¹, R², R³, R⁴ und R⁵, die gleich oder verschieden sind, ein Wasserstoffatom, einen C₁-C₆-Alkylrest, einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy, Halogen-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, Halogen-C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-Alkylsulfino, C₁-C₄-Alkylsulfinyl oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl substituierten C₁-C₆-Alkylrest, einen C₂-C₆-Alkenylrest, einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy, Halogen-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, Halogen-C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-Alkylsulfonyl substituierten C₂-C₆-Alkenylrest, einen C₂-C₆-Alkinylrest, einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy, Halogen-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, Halogen-C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-Alkylsulfonyl substituierten C₂-C₆-Alkinylrest, einen Halogen-C₁-C₄-Alkylsulfonyl substituierten C₂-C₆-Alkinylrest, ein Halogenatom, eine C₁-C₄-Alkoxygruppe, eine Halogen-C₁-C₄-alkoxygruppe, eine Gruppe R³-O-CO-, eine Aminocarbonylgruppe R³-R¹ON-CO-, eine Aminogruppe R³-R¹ON-, eine Cyanogruppe, eine Nitrogruppe, eine Schwefel enthaltende Gruppe R³-SO()n-, eine Acylgruppe R³-CO-, eine Gruppe R³-O-CO-(CH₂)n-, einen Phenoxyrest, einen durch C₁-C₄-Alkyl, Halogen oder Nitro substituierten Phenoxyrest,

R<sup>6</sup> ein Wasserstoffatom, eine Acylgruppe R<sup>8</sup>—CO—, eine Gruppe R<sup>8</sup>—O—CO—, einen C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>-Alkylrest, einen C<sub>2</sub>—C<sub>6</sub>-Alkenylrest, einen C<sub>2</sub>—C<sub>6</sub>-Alkinylrest, einen Phenyl-C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>-alkylrest, eine Aminocarbonylgruppe R<sup>9</sup>R<sup>10</sup>N—CO—, ein Alkalimetallatom, ein einwertiges Metalläquivalent aus der Gruppe der Erdalkalimetalle und weiterer Metalle, einen Ammoniumrest oder einen durch C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>-Alkyl substituierten Ammoniumrest,

R7 ein Wasserstoffatom, einen  $C_1-C_6$ -Alkylrest, einen durch Halogen und/oder  $C_1-C_4$ -Alkoxy substituierten  $C_1-C_6$ -Alkylrest, einen  $C_2-C_6$ -Alkenylrest, einen durch Halogen und/oder  $C_1-C_4$ -Alkoxy substituierten  $C_2-C_6$ -Alkenylrest, einen  $C_2-C_6$ -Alkinylrest, einen durch Halogen und/oder  $C_1-C_4$ -Alkoxy substituierten  $C_2-C_6$ -Alkinylrest, eine Halogenatom, eine Hydroxygruppe, einen  $C_1-C_6$ -Alkoxyrest, einen Halogen- $C_1-C_6$ -Alkoxyrest, eine Schwefel enthaltende Gruppe  $R^8-S(O)_n$ —oder eine Aminogruppe  $R^8$ - $R^8$  ein Wasserstoffatom, einen  $R^8$ - $R^8$ -einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy oder  $R^8$ -Alkoxy substituierten  $R^8$ -Alkylrest, einen  $R^8$ -Alkylrest, einen

ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy oder  $C_1-C_4$ -Alkoxy substituierten  $C_2-C_6$ -Alkenylrest, einen  $C_2-C_6$ -Alkinylrest, einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy oder  $C_1-C_4$ -Alkoxy substituierten  $C_2-C_6$ -Alkinylrest, einen Phenyl- $C_1-C_4$ -alkylrest, einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy oder  $C_1-C_4$ -Alkoxy substituierten Phenyl- $C_1-C_4$ -alkylrest, einen Phenylrest oder einen durch Halogen, Nitro oder  $C_1-C_4$ -Alkyl substituierten Phenylrest,

 $R^9$  ein Wasserstoffatom, einen  $C_1-C_6$ -Alkylrest, einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy oder  $C_1-C_4$ -Alkoxy substituierten  $C_1-C_6$ -Alkylrest, einen  $C_2-C_6$ -Alkenylrest, einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy oder  $C_1-C_4$ -Alkoxy substituierten  $C_2-C_6$ -Alkenylrest, einen  $C_2-C_6$ -Alkinylrest, einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy oder  $C_1-C_4$ -Alkoxy substituierten  $C_2-C_6$ -Alkinylrest,

Halogen, Hydroxy oder  $C_1 - C_6$ -Alkylrest, einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy oder  $C_1 - C_6$ -Alkylrest, einen  $C_1 - C_6$ -Alkylrest, einen  $C_2 - C_6$ -Alkenylrest, einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy oder  $C_1 - C_4$ -Alkoxy substituierten  $C_2 - C_6$ -Alkenylrest, einen  $C_2 - C_6$ -Alkinylrest, einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy oder  $C_1 - C_4$ -Alkoxy substituierten  $C_2 - C_6$ -Alkinylrest, einen  $C_2 - C_6$ -Alkinylrest, oder

R<sup>9</sup> und R<sup>10</sup> gemeinsam mit dem benachbarten Stickstoffatom eine Pyrolidinylgruppe, eine Piperidinogruppe oder eine Morpholinogruppe und

n0, 1 oder 2
bedeuten.
20

2. Pyrido[3,2-e][1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-sulfonsäureamide gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß in der allgemeinen Formel I Ar eine Phenylgruppe der allgemeinen Formel

$$R^4$$
 $R^5$ 
 $R^2$ 
 $R^1$ 

R<sup>1</sup> und R<sup>5</sup>, die gleich oder verschieden sind, ein Halogenatom, einen Methylrest, einen Trifluormethylrest, eine Nitrogruppe, einen Methoxyrest oder eine Methoxycarbonylgruppe,

 $R^2$ ,  $R^3$  und  $R^4$ , die gleich oder verschieden sind, ein Wasserstoffatom, ein Halogenatom, einen Trifluormethylrest oder einen  $C_1 - C_4$ -Alkylrest,

R<sup>6</sup> ein Wasserstoffatom, ein einwertiges Metalläquivalent oder eine C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>-Acylgruppe und

 $R^7$  ein Wasserstoffatom, einen  $C_1 - C_4$ -Alkylrest, einen  $C_2 - C_4$ -Alkenylrest oder einen  $C_1 - C_4$ -Alkoxyrest bedeuten.

3. Verfahren zur Herstellung von Pyrido[3,2-e][1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-sulfonsäureamiden der allgemeinen Formel I, dadurch gekennzeichnet, daß man

A) Amine der allgemeinen Formel II

in der Ar die unter der allgemeinen Formel I angegebene Bedeutung hat und  $R^{11}$  ein Wasserstoffatom, einen  $C_1-C_6$ -Alkylrest, einen  $C_2-C_6$ -Alkenylrest oder einen  $C_2-C_6$ -Alkinylrest bedeutet, mit einem Sulfonsäurechlorid der allgemeinen Formel III

$$\begin{array}{c|c}
N-N \\
0 \\
N-N \\
R^{7}
\end{array}$$
(III)

in der  $\mathbb{R}^7$  die unter der allgemeinen Formel I angegebene Bedeutung hat, in einem geeigneten Lösungsmittel in Gegenwart eines Säureakzeptors umsetzt,

B) eine Verbindung der allgemeinen Formel IV

65

60

45

$$A_{1}-N-S \qquad NH_{2} \qquad (IV)$$

$$R^{\parallel} \qquad 0$$

in der Ar und  $\mathbb{R}^{11}$  die unter der allgemeinen Formel II angegebenen Bedeutungen haben, mit 2-Chlornicotinsäure der Formel V

in einem geeigneten Lösungsmittel in Gegenwart eines Säureakzeptors und weiterer Katalysatoren zu Verbindungen der allgemeinen Formel Ia

$$Ar = N - S$$

$$R^{11} O$$

$$N = N$$

$$N =$$

in der Ar und  $\mathbb{R}^{11}$  die unter der allgemeinen Formel II angegebenen Bedeutungen haben, umsetzt, C) eine Verbindung der allgemeinen Formel Ia

$$\begin{array}{c|c}
N-N & \text{(Ia)} \\
O & N-N & \text{OH} \\
R^{11} & O & \text{OH}
\end{array}$$

in der Ar und R<sup>11</sup> die unter der allgemeinen Formel II angegebenen Bedeutungen haben, mit einem Halogenierungsreagenz in einem geeigneten Lösungsmittel in Gegenwart eines Katalysators zu Verbindungen der allgemeinen Formel Ib

$$Ar-N-S | N-N | Hal$$

$$R^{11} O$$

in der Ar und R<sup>11</sup> die unter der allgemeinen Formel II angegebenen Bedeutungen haben und Hal ein Halogenatom bedeutet, umsetzt, D) eine Verbindung der allgemeinen Formel Ia !

5

15

40

in der Ar und R11 die unter der allgemeinen Formel II angegebenen Bedeutungen haben, mit Lawesson's Reaganz oder Phosphorpentasulfid in einem geeigneten Lösungsmittel und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators zu Verbindungen der allgemeinen Formel Ic

$$\begin{array}{c|c}
N-N & (Ic) \\
N-N-S & N-SH \\
R^{\parallel} & O
\end{array}$$

in der Ar und R11 die unter der allgemeinen Formel II angegebenen Bedeutungen haben, umsetzt, E) eine Verbindung der allgemeinen Formel Ib

in der Ar und R11 die unter der allgemeinen Formel II angegebenen Bedeutungen haben und Hal ein Halogenatom bedeutet, mit einem Alkohol der allgemeinen Formel VI

$$HO-R^{12}$$
 (VI)

in der R<sup>12</sup> einen C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylrest oder einen Halogen-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylrest bedeutet, mit einer Schwefel enthaltenden Verbindung der allgemeinen Formel VII

der allgemeinen Formel VIII

H-NR9R10 (VIII) 55 der allgemeinen Formel Id 60 65

in der Ar und  $R^{11}$  die unter der allgemeinen Formel II angegebenen Bedeutungen haben und  $R^{13}$  einen  $C_1-C_6$ -Alkoxyrest, einen Halogen- $C_1-C_6$ -alkoxyrest, eine Schwefel enthaltende Gruppe  $R^8-S(O)_n$ — oder eine Aminogruppe  $R^9R^{10}N$ — bedeutet, wobei  $R^8$ ,  $R^9$ ,  $R^{10}$  und n die unter der allgemeinen Formel I angegebenen Bedeutungen haben, umsetzt,  $R^8$ ,  $R^9$ ,  $R^{10}$  und  $R^8$  die unter der allgemeinen Formel Ic

$$A_{\Gamma} = N - S$$

$$\downarrow N - N$$

$$\downarrow N$$

in der Ar und  $\mathbb{R}^{11}$  die unter der allgemeinen Formel II angegebenen Bedeutungen haben, mit einer Verbindung der allgemeinen Formel IX

$$\begin{array}{c|c}
C & CH - CI \\
R^{\mu} & (IX)
\end{array}$$

in der  $R^{14}$  ein Wasserstoffatom, einen  $C_1-C_5$ -Alkylrest, einen  $C_2-C_5$ -Alkenylrest oder einen  $C_2-C_5$ -Alkinylrest bedeutet, in einem geeigneten Lösungsmittel in Gegenwart eines Säureakzeptors und gegebenenfalls eines Katalysators zunächst zu Verbindungen der allgemeinen Formel X

$$Ar - N - S \qquad (X)$$

$$Ar - N - S \qquad N \qquad N$$

$$R^{10} \qquad 0$$

$$HO$$

in der Ar und R<sup>11</sup> die unter der allgemeinen Formel II und R<sup>14</sup> die unter der allgemeinen Formel IX angegebenen Bedeutungen haben, und anschließend durch Erhitzen in einem geeigneten Lösungsmittel in Gegenwart einer Base in einer Retro-Aldol-Reaktion zu Verbindungen der allgemeinen Formel Ie

$$A_{1}-N-S \\ \downarrow \\ \downarrow \\ R^{\parallel} \\ 0$$

$$CH_{2}-R^{\parallel}$$

$$CH_{2}-R^{\parallel}$$

in der Ar und R<sup>11</sup> die unter der allgemeinen Formel II und R<sup>14</sup> die unter der allgemeinen Formel IX angegebenen Bedeutungen haben, umsetzt,

10

55

60

G) eine Verbindung der allgemeinen Formel If

$$\begin{array}{c|c}
N-N \\
0 \\
N-N \\
R^{15}
\end{array}$$
(I1)
$$\begin{array}{c|c}
20 \\
R^{15}
\end{array}$$

in der Ar und R<sup>7</sup> die unter der allgemeinen Formel I angegebenen Bedeutungen haben und R<sup>15</sup> ein Wasserstoffatom oder ein einwertiges Metalläquivalent bedeutet, mit Verbindungen der allgemeinen Formel XII

oder der allgemeinen Formel XIII

in denen R<sup>8</sup> die unter der allgemeinen Formel I genannte Bedeutung hat, aber nicht für ein Wasserstoffatom steht, und Hal Chlor oder Brom bedeutet, oder der allgemeinen Formel XIV

$$R^8-CO-O-CO-R^8$$
 (XIV)

in der  $\mathbb{R}^8$  die oben genannte Bedeutung hat, in einem geeigneten Lösungsmittel umsetzt, H) eine Verbindung der allgemeinen Formel Ig

$$\begin{array}{c|c}
N-N \\
0 \\
N \\
N \\
N
\end{array}$$
(Ig)
$$A_{\Gamma}-N-S \\
N \\
N \\
N$$

$$R'$$

in der Ar und R<sup>7</sup> die unter der allgemeinen Formel I angegebenen Bedeutungen haben, mit einer Verbindung der allgemeinen Formel XV

$$M-Y$$
 (XV)

in der M ein einwertiges Metalläquivalent und Y ein Wasserstoffatom, eine Hydroxy-, Niederalkyl-, Niederalkoxy- oder Aminogruppe bedeutet, in einem Lösungsmittel umsetzt.

- 4. Mittel mit herbizider, pflanzenwachstumsregulierender und fungizider Wirkung, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einer Verbindung gemäß den Ansprüchen 1 und 2.
- 5. Verwendung von Mitteln gemäß dem Anspruch 4 zur Bekämpfung monokotyler und dikotyler Unkrautarten in landwirtschaftlichen Hauptkulturen.
- 6. Verwendung von Mitteln gemäß dem Anspruch 4 zur Wachstumsbeeinflussung von Kulturpflanzen.
- 7. Verwendung von Mitteln gemäß dem Anspruch 4 zur Bekämpfung eines Pilzbefalles in landwirtschaftli-

chen Kulturen. 8. Verfahren zur Herstellung von Mitteln mit herbizider, wachstumsregulierender und fungizider Wirkung, dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen der allgemeinen Formel I gemäß den Ansprüchen 1 und 2 mit Träger- und/oder Hilfsstoffen vermischt.